

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年3月10日 (10.03.2005)

PCT

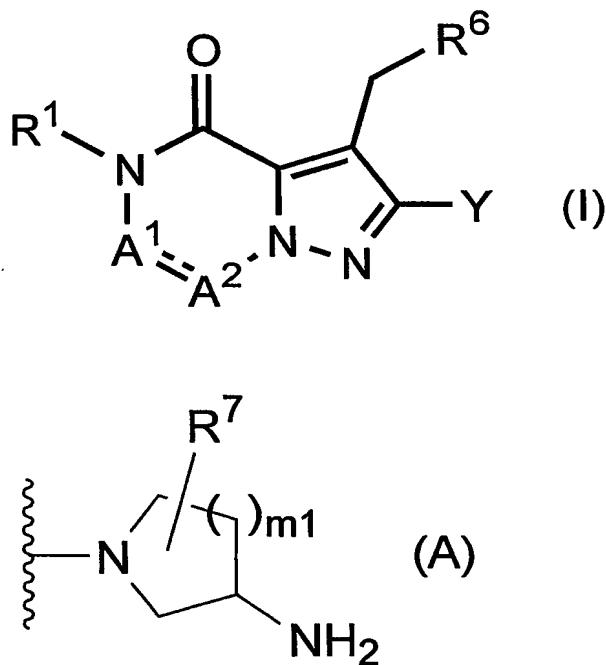
(10)国際公開番号  
WO 2005/021550 A1

(51) 国際特許分類 <sup>7</sup> :	C07D 487/04, A61K 31/4985, A61P 3/10, 43/00	LTD.) [JP/JP]; 〒5418510 大阪府大阪市中央区道修町 2丁目2番8号 Osaka (JP).
(21) 国際出願番号:	PCT/JP2004/012617	(72) 発明者; および
(22) 国際出願日:	2004年8月25日 (25.08.2004)	(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中平 博之 (NAKAHIRA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大 阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株 式会社内 Osaka (JP). 方達 均 (HOCHIGAI, Hitoshi) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁 目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 竹田 達也 (TAKEDA, Tatsuya) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府 大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製 薬株式会社内 Osaka (JP). 小林 友則 (KOBAYASHI, Tomonori) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春 日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). ヒューム ウィリアム ユーワン (HUME, William Ewan) [GB/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日
(25) 国際出願の言語:	日本語	
(26) 国際公開の言語:	日本語	
(30) 優先権データ:	特願2003-306948 2003年8月29日 (29.08.2003) JP	
(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友製薬 株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO.,		

[続葉有]

(54) Title: BICYCLIC PYRAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 二環性ピラゾール誘導体



(57) Abstract: A compound represented by the following formula (I), a prodrug thereof, or a pharmaceutically acceptable salt of either. These are compounds having high DPP-IV inhibitory activity and improved in safety, nontoxicity, etc. (I) [In the formula, R<sup>1</sup> represents hydrogen, optionally substituted alkyl, etc.; the solid line and dotted line between A<sup>1</sup> and A<sup>2</sup> indicate a double bond (A<sup>1</sup>=A<sup>2</sup>), etc.; A<sup>1</sup> represents a group represented by the formula C(R<sup>2</sup>), etc.; A<sup>2</sup> represents a group represented by the formula C(R<sup>4</sup>), etc.; R<sup>2</sup> represents hydrogen, optionally substituted alkyl, etc.; R<sup>4</sup> represents hydrogen, optionally substituted alkyl, etc.; R<sup>6</sup> represents hydrogen, optionally substituted aryl, etc.; and -Y represents, e.g., a group represented by the formula (A): (A) (wherein m<sub>1</sub> is 0, 1, 2, or 3; and R<sup>7</sup> is absent, or one or two R<sup>7</sup>'s are present and each independently represents optionally substituted alkyl, etc.).]

(57) 要約: DPP-IV 阻害活性が高く、安全性、毒性等で改善された化合物として、下記式 (I) で表される化合物もしくはそのプロドラッグ、またはそれらの薬学上許容される塩を提供する。[式中、R<sup>1</sup>は水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。A<sup>1</sup>とA<sup>2</sup>間の実線および点線は、二重結合 (A<sup>1</sup>=A<sup>2</sup>) 等を表す。A<sup>1</sup>は、式C (R<sup>2</sup>) で表される基等を表す。A<sup>2</sup>は、式C (R<sup>4</sup>) で表される基等を表す。R<sup>2</sup>は水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>4</sup>は水素原子、置換されてもよいアリール基等を表す。-Yは式 (A) で表される基等を表す。(m<sub>1</sub>は0、1、2または3を表し、R<sup>7</sup>は、存在しないか、1つまたは2つ存在し、各々独立して、置換されてもよいアルキル基等を表す。)]

WO 2005/021550 A1

もよいアルキル基等を表す。R<sup>4</sup>は水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>6</sup>は水素原子、置換されてもよいアリール基等を表す。-Yは式 (A) で表される基等を表す。(m<sub>1</sub>は0、1、2または3を表し、R<sup>7</sup>は、存在しないか、1つまたは2つ存在し、各々独立して、置換されてもよいアルキル基等を表す。)



出中 3 丁目 1 番 98 号 住友製薬株式会社内 Osaka  
(JP).

(74) 代理人: 五十部 積 (ISOBE, Yutaka); 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中 3 丁目 1 番 98 号 住友製薬株式会社 知的財産部内 Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。